PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number:

52-071481

(43)Date of publication of application: 14.06.1977

(51)Int.CL

C07D401/02 // A61K 31/505 A61K 31/505 A61K 31/505 A61K 31/505

A61K 31/505 (C07D401/02 C07D213/36 C07D239/56

(21)Application number: 50-147810

(71)Applicant: YOSHITOMI PHARMACEUT IND

LTD

(22)Date of filing:

10.12.1975

(72)Inventor: SHIRAKI MASAMI

(54) SYNTHESIS OF PYRIDYLPYRIMIDINES

(57) Abstract:

PURPOSE: Pyridylpyrimidines of formula I (Py is 2-,3-, or 4-pyridyl; R1 is H, lower alkyl; R2 is OH, lower alkoxy, or phenyl, which may be substituted by halogen, lower alkyl); for example, 2-ethoxycarbonylmethylthio-4hydroxy-6-(2-pyridyl)pyrimidine.

LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

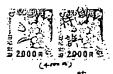
[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2000 Japan Patent Office



頭

昭和 11 年 11 月 10 日

特許介存在 事 画

1. 発明の名称

My セイゾウホウ ビリジルビリミジン類の製造法

2. 発 明 者

台 ナルシャオフザルミナナガ 大分県中部市大学上音本 9 6 0 番地の 5 シロ キ サッ 白 本 政 巳

(11 to 4 42)

3/20

3. 特許出顧人

住 所; 大阪市東区平野町3丁目35番地 名称 吉富製菜株式会社 代表者 田 坂 元 祐

4.代 理 人 〒541

住 所 大阪市東区平野町 3 丁目35番地 吉富製薬株式会社内

氏名 弁理士(6630) 高宮坂

5. 承付審額の目録

(1) 時 日 25

(2) 委任 扶 1 通

(3) 特許問題本 1 湯

50 147810

L 発明の名称

ピリジルピリミジン型の製造法

1. 特許額水の戦闘

て交わされる化合物に、一般式

で表わされる化合物を反応させることを特徴とす

る、一般式

て表わされるビリジルビリミジン類の製造法。

19 日本国特許庁

公開特許公報

①特開昭 52-71481

43公開日 昭 52. (1977) 6 14

②特願昭 50-7478[0

②出願日 昭 40. (197 分 /2. 10

審查請求 未請求

(全3頁)

庁内整理番号 5921 44 7009 44 6617 44 5921 44

520日本分類	51 Int. Cl ² :	識別記号			
16 E461	C070401/02				
30 87/33.42 30 H111.5 30 H22 30 H612 30 H111 30 H321.5	A61K 31/505	AAH			
	/	ABE			
	/	ADZ			
	/	ABU			
30 H44	/	ADP			
	(CO70401/02				
ĺ	C070213/36				
最終はへつづく					

C式中、Prは1-.1-又は1-ビリジル基を、 R ¹ は水滑叉は低級アルキル基を、R ² はヒドロ キシ、低級アルコキシ、あるいは同一又は呉つて 1~140のハロゲン、低級アルキル、低級アルコ ナシ、ヒドロキシ、ニトロ、ポリハロ仕級アルキ ルを関換基として有していてもよいフェニル甚を、 エはハロゲン又は活性エステルの軟鉄基を示す。〕

1 発明の詳細な説明

本発明は、一般式

〔式中、2gは1ー、3−又は1−ビリジル基を、 Blt水準又は低級アルキル基(メナル、エナル、 プロピル、ブチルなど)を、B2はヒドロキシ茲、 低級アルコキン基(メトキシ、エトキシ、プロポ

キン、プトキンなど)、あるいは四一又は其つて しつ 1 但のハロゲン(ファ栗、塩素、臭黒、ヨウ 素)、低級アルキル、低級アルコキン、にドロキ シ、ニトロ、ポリハロ低酸アルキル(トリアルオ パノナルなど)を質換品として有していてもよい フェニル基を示す。〕

で乗わされる新規なビリジルビリミジン類の製造 佐に黒する。

本発明方法によれば、一般式〔Ⅰ〕の化合物は、

一般式

〔式中、Pyは前配と同意義。〕

で表わされる化合物と、一般式

- 3 -

ルエン、ナトラヒドロフラン、ジメナルホルムア ミド、ジノナルスルホャナイド、メナルセルソル ブ、又はこれらの混合物などがあげられる。

反応は室道でも進行するが、たとえば50~

150でに加熱すれば速やかに発結する。

反応は、総合制及び単数利を乗れて、アルカリ (カセイソーダ、カセイカリ、重奮、鉄酸カリ、 鉄酸ソーダ、ナトリクムアルコラート、水素化ナ トリクム、金属ナトリクム、金属カリウム、ソン クムアミドなど)の存在に行えば、有利に進行せ しめることができる。

一般式(I)において R 2 が低級アルコキシを 表ナ化合物は、所質により、常体に従って、たと えばアルカリの存在下に加水分解反応に付し、一 般式(I)にかいて R 2 がにドロキシ基を示す化 合物に等くことができる。

-8-

特別 昭52-7 148 16) 〔武中、 8 ¹ 、 8 ⁸ は朝紀と國底祭。 1はハログ ン又は西性エステルの最後基を示す。 〕 で汲わされる化合物を反応させることにより製造 まれる。

なか、一般式(1)の化合物には、一般式

化合物[[]]と化合物[四]とを反応させて、化合物[]]を得る方法において、反応は面な、容 唯中加熱下に行なわれる。

溶媒としては、水、アルコール類(ノタノール、 エタノール、プロパノールなど)、ペンセン、ト

かくして得られた一般式([]の化合物は、塩 酸塩、臭化水素酸、延酸塩、シュウ酸塩、マレイ ン酸塩、フマール酸塩などの酸付加塩とすること ができる。

本発明の化合物は、銀稿、抗反症作用、抗菌作 体 用、中枢神経抑制作用、血圧が下作用、血結低下 作用を有し、これらの作用を有する磁薬品として 有用であるばかりでなく、更に低薬品製造の中間 体としても有用である。

実施例 L

2-ノルカプトー4-ヒドロキシー6-(2-ビリジル)ビリミジン4 8を敷和重費末!50 4 に魅闘せしめ、機杼下室級にて、プロム酢酸エチル198のエタノール!0 4の溶液を適下する。その後、室道にて5時間横岸し、3%複酸にて中性にすれば結晶が折出する。これを呼取し、水洗、

エタノール仕級後、エタノールから再結品して無 色の 2 ーエトキシカルポニルノナルチオー (一 c ドロキシー 6 ー (2 ービリジル) ビリミジンを得 る。 敬点 1 9 6 ~ 1 9 7 で

実施例し

2ーノルカプトー(ーヒドロキシー6ー(3ーピリジル)ピリミジン(gをジノナルホルムアミド 10世に懸めせしめ、接昇下室温にて水素化ナトリクム(3 1 % 転抽中) 0.9 1 6を加え、60 でにて 3 6分間標準後、窓區 法冷却し、フェナシルプロマイド 1 3 1 8を加えて、援押下に60で、1時間反応させる。反応終了後、本本100世を加え、折出する盟結品を呼取し、水洗後乾燥し、エタノールより再結品して、無色品の1ーペンゾイルノナルチオー4ーヒドロキシー6ー(3ーピリジル)ピリミジンを得る。酸な219~110

- 1 -

Æ	Py	Rl	R2	自血性
14	2-4922	Ħ	p-1102-Ph	
15	3-c15in	H	m CF y Ph	
16	,	Ħ	1,4-(OE)2-Fh	
17	,	Ħ	p-C1-Ph	
18	(-c)22c	Ħ	p-f-Ph	
19	2一七月入	H	o-0H-Ph	
20	•	Ħ	o-Cl-Ph	

Ph:フェニル基

代理人 介理士 高宫被



特開 叫52-7 148 1(3)

以下同様にして次の化合物を得た。

_				
-	Py	Rl	R ²	磁点位
1	3-07:20	CH3	p-Cl-Ph	218~219
2	•	Ħ	p-P-Pa	230-231
3	-	Ħ	p-CH ₃ -Ph	116~217
4	•	Ħ	1.4-(CH30)2-Ph	230~231
5	•	8	1.4.5-(CH3O)3-Pb	1/3 塩酸塩 21-3~114
6	مزون-1	Ħ	-ося ⁵ ся ²	
1	•	Ħ	OE	
	3-0920	н	-осн ₂ сн ₃	
,	,	н	OB	
10	معتراؤاته—4	EL	1.4.5-(CH3O)3-Ph	
11	•	E	1. ((CH3O)2-Ph	
12	•	Ħ	р-СВ30-Рь	
13	2-e1924	Ħ	p-Br-Pb	

--

庁内整理番号

52日本分類	51 Int. C12.	識別記号
	COTO 239/56)	
		İ